# ENGLISH MACHINE-MADE TRANSLATION OF WOO1/26618

# COMPOSITION, ESPECIALLY A COSMETIC COMPOSITION, CONTAINING A STEROID AND A LIPOSOLUBLE UV FILTER

Publication number: WO0126618

Publication date:

2001-04-19

Inventor:

BALDO FRANCINE (FR)

Applicant:

OREAL (FR); BALDO FRANCINE (FR)

Classification:

- international: A61K8/00; A61K8/30; A61K8/33; A61K8/35; A61K8/36;

A61K8/362; A61K8/365; A61K8/368; A61K8/37;

A61K8/40; A61K8/41; A61K8/46; A61K8/49; A61K8/55;

A61K8/58; A61K8/60; A61K8/63; A61K8/67; A61K8/73;

A61K8/89; A61K8/96; A61K8/97; A61K31/568; A61K31/5685; A61K31/57; A61K31/575; A61P17/00; A61P17/12; A61P43/00; A61Q5/00; A61Q5/08;

A61Q5/10; A61Q19/00; A61Q19/02; A61Q19/08; C07J1/00; C07J7/00; C07J9/00; A61K8/00; A61K8/30;

A61K8/72; A61K8/96; A61K31/568; A61K31/57; A61K31/575; A61P17/00; A61P43/00; A61Q5/00; A61Q5/08; A61Q5/10; A61Q19/00; A61Q19/02; A61Q19/08; C07J1/00; C07J7/00; C07J9/00; (IPC1-7):

A61K7/42; A61K7/48

- European:

A61K8/35; A61K8/368; A61K8/37; A61K8/40;

A61K8/46F; A61K8/49F1; A61K8/58C; A61K8/63;

A61Q19/00; A61Q19/02

Application number: WO2000FR02879 20001013 Priority number(s): FR19990012773 19991013

Also published as:

EP1092423 (A2) WO0126618 (A3) EP1221933 (A3) EP1221933 (A2) JP2001131072 (A)

more >>

#### Cited documents:



US5900242 US4542129 FR2760362 WO9710255

Report a data error here

#### Abstract of WO0126618

The invention relates to composition containing at least one steroid selected from: dihydroepiandrosterone and/or a biological precursor and/or a metabolic derivative thereof, in a physiologically suitable medium and characterised in that it also contains at least one liposoluble UV filter. Said liposoluble UV filter provides a means of preventing or delaying the crystallisation of the steroid. The invention also relates to the cosmetic and dermatological uses of the inventive composition, especially for preventing or treating chronological or actinic ageing of the skin.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide



	Description of W00126618	<u>Print</u>	Сору	Contact Us	Close	
--	--------------------------	--------------	------	------------	-------	--

#### Result Page

Notice: This translation is produced by an automated process; it is intended only to make the technical content of the original document sufficiently clear in the target language. This service is not a replacement for professional translation services. The esp@cenet® Terms and Conditions of use are also applicable to the use of the translation tool and the results derived therefrom.

Composition, in particular cosmetic, containing a steroid and a liposoluble filter UV

The present invention refers to a composition containing, in a physiologically acceptable medium, at least a steroid chosen among: the DHEA and/or a biological precursor and/or a metabolic derivative of this one, characterized in that it includes/understands moreover at least a liposoluble filter UV. It also refers to its uses, and a process of solubilization of the above mentioned steroid by means of to less one liposoluble filter UV.

The DHEA, or déhydroépiandrostérone, is a natural steroid produced primarily by corticosuprarenal glands. It is known for its capacity to promote keratinization of the skin (JP-07 196.467), or in the treatment of the dry skins, because of its aptitude < RTI ID=1.1> ci</RTI> to increase the endogenous production and the secretion of sebum and to reinforce the barrier effect of the skin < RTI ID=1.2> (US-4, < /RTI> 496,556). II was also described in patent US-5,843,932 < RTI ID=1.3> I' utilisation</RTI> DHEA to cure the atrophy of the derm by inhibition of the conjunctive fabric and collagen loss. II was finally proposed to use sulphate of DHEA to treat various signs of ageing such as the wrinkles, the loss of glare of the skin and the cutaneous relaxation (EP-0 723.775).

The intert is thus included/understood that there can be to use the DHEA in cosmetic or dermatological compositions.

However, the DHEA is solubilized only with difficulty in the mediums aqueous and hydroalcoolic, which limits its formulation in cosmetic or dermatological compositions applied by way topics or oral. It has tendency thus to to recristallize or to degrade itself. < RTI ID=1.4> II< /RTI> a loss of effectiveness follows more or less important of these compositions, according to the degree of recrystallization and/or degradation, which goes against the required objective. Moreover, this

recrystallization or degradation can modify the total stability of these compositions like their aspect, which can divert the user of those.

< RTI ID=1.5> II< /RTI> thus remain the need to solubilize the DHEA, like its precursors and/or derived posing problems Mrs. of recrystallization, in one solubilizing physiologically acceptable.

The Applicant now noted, in an astonishing way, that these compounds could tre easily solubilized in liposoluble filters UV.

The present invention thus has as an aim containing a composition, in a physiologically acceptable medium, at least a steroid chosen among: the DHEA < RTI ID=2.1> et/ou< /RTI> a biological precursor and/or a metabolic derivative of this one, characterized in that it includes/understands moreover at least a liposoluble filter UV.

It also has as an aim a process of solubilization of at least a steroid chosen among: the DHEA and/or a biological precursor and/or a metabolic derivative of celleci, including/understanding f stage consisting < RTI ID=2.2> to mix! edict steroid a</ri>

 $_{\rm L}$  top The mixture can tre carried out cold, at ambient temperature or hot, for example with < RTI ID=2.3> 75 C, < /RTI> generally under agitation.

The DHEA with the formula < RTI ID=2.4> (I) < /RTI> following: EMI2.1

The DHEA usable according to the invention is for example available near the company AKZO NOBEL.

< RTI ID=2.5> By " précurseurs< /RTI> biological " of the DHEA, one hears in particular the < RTI ID=2.6> A5-prégnénolone< /RTI> and the < RTI ID=2.7> 17a-hydroxy prégnénolone, < /RTI> without this list being restrictive.

By metabolic derivatives of the DHEA, one understands in particular the < RTI ID=2.8> A5-androstène-3, < /RTI> 17diol and A4-androstène-3, 17-dione, like < RTI ID=2.9> the 7uOH-DHEA, the 7;30H-DHEA< /RTI> and the 7< RTI ID=2.10> céto-DHEA, < /RTI> without this list being restrictive. The < RTI ID=2.11> 7aOH-DHEA< /RTI> is preferred for a use in the present invention.

The composition according to the present invention contains, like solubilizing steroids above, at least a liposoluble filter UV.

Like examples of liposoluble filters UV, one can quote: (1) derivatives of! 'acid salicylic such as the salicylate of homomenthyle, the salicylate of 2-éthylhexyle, the salicylate of < RTI ID=3.1> triéthanoiamine, < /RTI> the salicylate of < RTI ID=3.2> 4-isopropylbenzyle; < /RTI> (2) derivatives of! 'acid cinnamic such as the 4-méthoxy cinnamate of isopentyle, the < RTI ID=3.3> 4-méthoxy< /RTI> cinnamate of 2-éthylhexyle, the diisopropyl cinnamate of methyl, the 4< RTI ID=3.4> méthoxy< /RTI> cinnamate of isoamyl, the < RTI ID=3.5> 4-méthoxy< /RTI> cinnamate of < RTI ID=3.6> diethanolamine; < /RTI> (3) derivatives of < RTI ID=3.7> S, < /RTI> < RTI ID=3.8> -

diphénylacrylate < /RTI > liquids; (4) derivatives of! 'acid < RTI ID=3.9> para-aminobenzoīque < /RTI > such as the < RTI ID=3.10> p-diméthylaminobenzoate < /RTI > of 2-éthylhexyle and the p-aminobenzoate of glycerol; (5) derivatives of < RTI ID=3.11> dibenzoylmethane < /RTI>; (6) liposoluble benzophenone < derivatives; RTI ID=3.12> ; < /RTI> (7) silicones benzotriazoles described in particular in the patent application EP-A0 392.883; (8) the derivatives < RTI ID=3.13> siliciés < /RTI> of Benzimidazolyl-Benzazoles N-substituted or Benzofuranyl < RTI ID=3.14> Benzazoles < /RTI> described in particular in the patent application EP-1 028.120; and (9) their mixtures.

Among the derivatives of the salicylic acid usable according to the invention, one will choose more particularly: it salicylate of homomenthyle (known also under the name of homosalate), sold in particular under the denomination of "KEMESTER HMS" by the Witco Company. II answers the following formula: EMI4.1

< RTI ID=4.1> it < /RTI> octyl salicylate sold in particular under the trade description of ?UVINUL 0-18 " by Company BASF, and it answers the following formula: EMI4.2

< RTI ID=4.2> derived, -diphénylacrylates< /RTI> liquids usable according to the present invention are preferably selected among those answering the following formula:

in which: < RTI ID=4.3> - R7 and R'7, < /RTI> identical or different, are in position méta or para and are selected among: hydrogen; a < RTI ID=4.4> radica! aicoxy in CICS with chaîne< /RTI> right-hand side or ramified; a radical alkyl < RTI ID=4.5> out of Cr-C4 with chaîne< /RTI> right-hand side or ramified; - R8 represents a radical alkyl < RTI ID=4.6> out of C, - C, 2 with chain droite< /RTI> or ramified; < RTI ID=5.1> - Rg< /RTI> represent a hydrogen atom or a < RTI ID=5.2> radical-CN.< /RTI>

Among < RTI ID=5.3> the derivatives p, '- diphénylacrylates liquides < /RTI> of formula (V) usable according to the present invention, one prefers < more particularly; RTI ID=5.4> I' a-cyano-p, < /RTI> < RTI ID=5.5> p'< /RTI> < RTI ID=5.6> diphénylacrylate < /RTI> of 2-éthylhexyle, still called < RTI ID=5.7> octocrylene, < /RTI> and known for tre a lipophilic filter absorbing in the UVB. < RTI ID=5.8> II < /RTI> available and is commercially sold in particular under the denomination of " UVINUL NR 539 " by Company BASF. it answers the following formula: EMI5.1

in which < RTI ID=5.9 > f < /RTI > indicate a radical phenyl.

Among the derivatives of the cinnamic acid mentioned above, one prefers particularly, according to the present invention, to implement the p-méthoxycinnamate 2-éthylhexyle, sold in particular under the commercial name PARSOL MCX by

Company < RTI ID=5.10> GIVAUDAN< /RTI> ; this filter answers the following developed formula: EMI5.2

Among the derivatives of! 'acid < RTI ID=6.1> p-aminobenzoic, < /RTI> one will more particularly choose the paradiméthylaminobenzoate of 2-éthylhexyle sold in particular under the denomination of " ESCALOL 507 " by Company ISP.

As derived from dibenzoylméthane, one prefers in particular to use the < RTI ID=6.2> 4 - (tert-butyl) < /RTI> < RTI ID=6.3> 4 ' - méthoxy< /RTI> dibenzoylméthane, in particular that proposed with the sale under the trade description of " PARSOL 1789 " by Company GIVAUDAN.

Among the liposoluble benzophenone derivatives, one can quote the 2-hydroxy-4< RTI ID=6.4> méthoxy-benzophenone, < /RTI> still called oxybenzone (benzophenone-3) like produces it sold under name UVINUL M40 by company BASF.

Like silicones benzotriazoles, one prefers to use the compound of following formula, or < RTI ID=6.5> 2 - (2H-benzotriazoie-2-yt) - 4-méthy! - 6 - [2-méthyi-3- [1, < /RTI> 3,3,3-tétraméthyl-1 [(triméthylsilyl) oxy] < RTI ID=6.6> disiloxanyl] < /RTI> < RTI ID=6.7> propynyl] < /RTI> phenol: EMI6.1

The derivatives < RTI ID=6.8> siliciés< /RTI> of Benzimidazolyl-Benzazoles N-substituted or Benzofuranyl< RTI ID=6.9> Benzazoles< /RTI> being appropriate particularly well for a use in the present invention are in particular: < RTI ID=6.10> it < /RTI> 2- [1 - [3 - [1, 3,3,3-tétraméthyl-1- [(triméthylsilyl) oxy] disiloxanyl] < RTI ID=6.11> propyl] - 1< /RTI> Hbenzimidazol-2-yl] - benzoxazole < RTI ID=6.12> - ie2- [1 - [3 - [1, < /RTI> 3,3,3-tétraméthyl-1- [(triméthylsilyl) oxy] disiloxanyl] < RTI ID=6.13> propyl] - 1 H-< /RTI> benzimidazol-2-yl] - benzothlazole it < RTI ID=6.14> 2 - [1 - (3-trimethylsilanyl-propyl) - 1 H-benzimidazol-2-yl] - benzoxazole< /RTI> it < RTI ID=7.1> 6- methoxy-1, < /RTI> < RTI ID=7.2> 1 ' - (a) (3-triméthylsilanyl-propyl) - 1 H, 1 ' H [2, < /RTI> 2 '] < RTI ID=7.3> bibenzimidazolyl-< /RTI> < RTI ID=7.4> benzoxazole it 2 - [1 - (3-trimethylsilanyl-propyl) - 1 H-benzimidazol-2-yl] - benzothiazole.< /RTI>

The concentration in steroid in the composition according to the invention advantageously lies between 0,001% and 20% in weight, preferably between 0,01 and 10% in weight, more preferentially between 0,1 and 3% in weight, compared to the total weight of the composition. Moreover, the ponderal quantity of liposoluble filter UV represents advantageously from 0,5% to 20%, better, from 0,1 to 10%, the total weight of the composition.

The composition according to the invention can arise in all the galenic forms normally used for a topics application on the skin, in particular in the form of an oily solution, of an emulsion oil-in-water or water-in-oil or multiple, of a siliconée emulsion, a microémulsion or nanoémulsion, a gel oily or of an anhydrous product liquidates, pasty or solid.

This composition can tre more or less fluid and to have the aspect of a white cream or coloured, of a pomade, a milk, a lotion, a serum, a paste, one foam or of a gel. It can possibly tre applied to the skin in form of aerosol. It can be also presented in solid form, and for example under form stick. It can tre used as product of care and/or product of

make-up of the skin, or like produces capillary, for example like shampoo or conditioner.

In a known way, the composition of the invention can also contain the additives usual in the fields cosmetic and dermatological, such as gelling absorbent or lipophilic, absorbent or lipophilic credits, conservatives, them antioxydants, solvents, perfumes, loads, pigments, absorbers of odor and dyes. The quantities of these various additives are those classically used in the fields considered, and for example of 0,01 with 20% of the total weight of the composition. These additives, according to their nature, can tre introduced into the fatty phase, the aqueous phase, the lipidic blisters and/or in the nanoparticules. These additives, like their concentrations, owe tre such as its do not harm the advantageous properties of the steroids according to the invention.

Thus, according to the Solar Factor of Protection that < RTI ID=8.1> one < /RTI> wish to confer on the composition according to the invention, this one will be able advantageously to contain one or more water-soluble filters UV.

Like examples of water-soluble filters UV, one can quote: (1) filters derived from the benzylidene camphor, whose example particularly preferred is acid I' benzene 1,4 - [di (3-méthylidènecampho 10-sulphonic)] described in particular in the patent applications FR-A-2 528.420 and FR-A-2 639.347; (2) filters of the < type; RTI ID=8.2> benzimidazole
RTI ID=8.3> benzoxazole, < /RTI> such as < RTI ID=8.4> you acid 2-phény! < /RTI> 
RTI ID=8.5> benzimidazole
/RTI> 5-sulphonic, available near the MERCK company under trade description EUSOLEX 232; (3) water-soluble benzophenone derivatives, such as acid I' < RTI ID=8.6> 2-hydroxy-4-méthoxy/RTI> < RTI ID=8.7> benzophenone-5-sutfonique, < /RTI> like its shape sulphonate of sodium (benzophénone5) sold under the name < RTI ID=8.8> UVINUL
/RTI> Ms 40 by company BASF; and
(4) their mixtures.

When the composition according to the invention is an emulsion, the proportion of the fatty phase can go from 5 to 80% in weight, and preferably from 5 to 50% in weight by report/ratio with the total weight of the composition. Fat content, emulsifiers and the coémulsionnants used in the composition in the form of emulsion are selected among those classically used in the field considered. The emulsifier and it coémulsionnant are preferably present, in the composition, in a proportion going from 0,3 to 30% in weight, and preferably from 0,5 to 20% in weight compared to total weight of the composition.

Like fat content usable in the invention, one can use with base 2-alkyl < RTI ID=8.9> alcanols< /RTI> and their esters, oils and in particular oils < RTI ID=9.1> minorâtes< /RTI> (petroleum jelly oil), oils of vegetable origin (oil of lawyer, soya oil), oils of animal origin (lanolin), oils of synthesis (perhydrosqualene), oils siliconées (cyclométhicone) and fluorinated oils < RTI ID=9.2> (perfluoropolyéthers). < /RTI> One can also use as fat content of fatty alcohols such as < RTI ID=9.3> I' alcool< /RTI> cetyl, of the fatty acids, waxes and gums and in particular silicone gums.

Like emulsifiers and coémulsionnants usable in the invention, one can quote for example esters of fatty acid and polyethylene glycol such as stearate of

PEG-100, the stearate of PEG-50 and the stearate of PEG-40; esters of fatty acid and polyol such as stearate of < RTI ID=9.4> glycéryle, < /RTI> the < RTI ID=9.5> tristéarate< /RTI> of sorbitane and stearates of sorbitane oxyéthylénés available under the trade descriptions < RTI ID=9.6> Tween@< /RTI> 20 or Tween (D 60, for example; and their mixtures.

Like gelling absorbent, one can quote the polymers < in particular; RTI ID=9.7> carboxyvinyliques< /RTI> (carbomer), acrylic copolymers such as the copolymers < RTI ID=9.8> acrylates/alkylacrylates, < /RTI> polyacrylamides, polysaccharides, gums

natural and clays, and, like gelling lipophilic, one can quote clays modified like the bentones, metal salts of fatty acids and silica hydrophobic subject.

The composition according to the invention finds in particular an application in prevention and treatment of the signs of chronological or actinic ageing, like in the treatment of certain pathologies.

The present invention thus relates to also the cosmetic use of composition mentioned above to prevent or treat the signs of ageing cutaneous chronological or actinic, in particular wrinkles and ridules and/or it cutaneous relaxation.

More particularly, the composition according to the invention is intended for the prevention or with the treatment of actinic ageing.

The present invention also relates to the use of the composition mentioned above to manufacture a preparation intended to prevent or treat the signs of chronological or actinic cutaneous ageing.

In all the cases, the composition according to the invention and/or the preparation obtained from this one includes/understands an effective of steroid, sufficient quantity to obtain the sought effect, and a physiologically acceptable medium

The invention will be now illustrated for the examples nonrestrictive following. In these examples, the quantities are indicated ponderal expressed as a percentage, unless otherwise specified.

#### **EXAMPLES**

Example 1: description of the solubilizing effect of liposoluble filters UV

•

One prepares three C1 compositions in C3 such as defined in Table 1. TABLE 1 C1 C2 C3 Distéarate < RTI ID=10.1> polyglycérolé< /RTI> (2 < RTI ID=10.2> mol) 2%.2%.2% < /RTI> Mono-stearate of PEG (8 < RTI ID=10.3> OE) < /RTI> 1,35% 1,35% 1,35% Acid stearic 1%.1%.1% Conservatives 1,35% 1,35% 1,35% DHEA 1 < RTI ID=10.4> %< /RTI> 1 % 1 % Octyl méthoxycinnamate 5%.0%.0% < RTI ID=10.5> Octocrylène< /RTI> 0%.5%.0% < RTI ID=10.6> Alcohol benzoate out of C, 2, s< /RTI> 15% 20% 25% Neutralizing < RTI ID=10.7> 0, < /RTI> < RTI ID=10.8> 45% < /RTI> 0,45% 0,45% Propylene glycol 10% 10% 10% Gelling 0,5% 0,5% 0,5% Water qsp 100% qsp 100% qsp 100% After fifteen days with < RTI ID=11.1> 4 C< /RTI> or at ambient temperature, the C1 compositions and C2 do not present crystals of DHEA, while the C3 composition presents already crystals of DHEA, visible with the microscope under polarized light, at the end of 24 hours of storage to < RTI ID=11.2> 4 C< /RTI> or at ambient temperature. < RTI ID=11.3> II< /RTI> thus arises clearly from Table 1 that liposoluble filters UV make it possible to solubilize the DHEA, or another steroid. Example 2: cosmetic composition < RTI ID=11.4> Buty! méthoxy dibenzoytméthane< /RTI> 5% < RTI ID=11.5> 7aOH-DHEA</RTI> 1 % Distéarate < RTI ID=11.6> polyglycérolé< /RTI> (2 mol) 2% Mono-stearate of PEG (8 < RTI ID=11.7> OE) < /RTI> 1,35 % Acid stearic 1% Propylene glycol 10% Conservative 1,35% Gelling 0,5% Neutralizing < RTI ID=11.8> 0, < /RTI> < RTI ID=11.9> 45% < /RTI> Water gsp 100% The composition above can tre used as cream of care intended to fight against the wrinkles and to prevent the loss of firmness and elasticity of the skin. Example 3: cosmetic composition < RTI ID=11.10> Octyl salicylate< /RTI> 5 % 7-céto-DHEA 1% Distéarate < RTI ID=11.11> polyglycérolé< /RTI> (2 mol) 2% Mono-stearate of PEG (8 OE) 1,35% Acid stearic 1% Propylene glycol 10% Conservative 1,35% Gelling 0.5 % Neutralizing < RTI ID=12.1> 0, < /RTI> 45 % Water gsp 100% The composition above can tre used as cream of < day; RTI ID=12.2> anti-âge.< /RTI> Example 4: cosmetic composition Silicone < RTI ID=12.3> benzotriazole\*< /RTI> 5 % DHEA 1% < RTI ID=12.4> Distéarate< /RTI> < RTI ID=12.5> polygfycéroté< /RTI> (2 mol) 2% Mono-stearate of PEG (8 < RTI ID=12.6> OE) < /RTI> 1,35 % Acid stearic 1% Propylene glycol 10 < RTI ID=12.7> %< /RTI> Conservative 1,35% Gelling 0,5% Neutralizing 0,45% Water qsp 100% < RTI ID=12.8> \* 2 (2H-benzotriazole-2-yl) - 4-methyl-6 [2-methyl-3-L 1,3,3,3-tetraméthyl-1-[(triméthylsilyl) oxy] < /RTI> disiloxanyl] propynyl] phenol, described in the patent application EP-A-0 392.883. This composition can tre used to prevent or treat the signs of ageing such as the wrinkles and ridules and the cutaneous relaxation.



Claims of WO0126618	<u>Print</u>	Сору	Contact Us	Close

#### Result Page

Notice: This translation is produced by an automated process; it is intended only to make the technical content of the original document sufficiently clear in the target language. This service is not a replacement for professional translation services. The esp@cenet® Terms and Conditions of use are also applicable to the use of the translation tool and the results derived therefrom.

- CLAIMS 1. Composition containing, in a physiologically acceptable medium, at least a steroid chosen among: the DHEA and/or a biological precursor and/or a chemical or metabolic derivative of this one, characterized in that it includes/understands moreover at least a liposoluble filter UV.
- 2. Composition according to claim 1, characterized in that the aforementioned biological precursor is selected among: < RTI ID=13.1> A5-prégnénolone</RTI> and < RTI ID=13.2> the 17a-hydroxy prégnénolone.</RTI>
- 3. Composition according to any of the preceding claims, characterized in that the aforementioned metabolic derivative is selected among: A5-androstène-3, 17-diol and the < RTI ID=13.3> A4-androstène-3, < /RTI> 17-dione, < RTI ID=13.4> the 7aOH-DHEA, the 7iOH-DHEA</RTI> and < RTI ID=13.5> the 7-céto-DHEA.</RTI>
- Composition according to claim 3, characterized in that the aforementioned derives metabolic is the < RTI ID=13.6>
  7aOH-DHEA.</RTI>
- 5. Composition according to any of the preceding claims, characterized in that it contains from 0,01 to 10% in weight of steroid, compared to the total weight of the composition.
- 6. Composition according to claim 5, characterized in that it contains of to 3% in weight of steroid, compared to the total weight of the composition.
- 7. Composition according to < RTI ID=13.7> one < /RTI> unspecified of the preceding claims, characterized in that the aforementioned liposoluble filter UV is selected: (1) derivatives of you acid salicylic; (2) derivatives of acid I' < RTI ID=13.8>; < /RTI> (3) derivatives of < RTI ID=13.9> S, < /RTI> < RTI ID=13.10> (3 ' diphénylacrylate< /RTI> liquids; (4) derivatives of acid I' < RTI ID=13.11> para-aminobenzoïque< /RTI>; (5) derivatives of < RTI ID=13.12> dibenzovlméthane
- (5) derivatives of < RTI ID=13.12> dibenzoylméthane< /RTI> ; (6) liposoluble derivatives of < RTI ID=13.13> benzophénone< /RTI> ;
- (7) silicones benzotriazoles; (8) the derivatives < RTI ID=14.1> siliclés< /RTI> of Benzimidazolyl-Benzazoles N-substituted or Benzofuranyl< RTI ID=14.2> Benzazoles< /RTI>; and (9) their mixtures.
- 8. Composition according to claim 7, characterized in that < RTI ID=14.3> the aforementioned derivé</RTI> of salicylic acid is selected among salicylate < RTI ID=14.4> of octyle</RTI> and the salicylate of homomenthyle.
- 9. Composition according to claim 7, characterized in that the aforementioned derivative of cinnamic acid is the 4-méthoxycinnamate of < RTI ID=14.5> 2-éthylhexyle.</RTI>
- 10. Composition according to claim 7, characterized in that the aforementioned derivative of < RTI ID=14.6> S, < /RTI> < RTI ID=14.7> P'-< /RTI> < RTI ID=14.8> diphénylacrylate< /RTI> ID=14.9> I' a-cyano-p, < /RTI> < RTI ID=14.10> diphénylacrylate< /RTI> of < RTI ID=14.11> 2-éthylhexyle.< /RTI>
- 11. Composition according to claim 7, characterized in that the aforementioned derivative of dibenzoylméthane is < RTI ID=14.12> 4 (tert-butyl) 4 ' méthoxy dibenzoylméthane.< /RTI>
  - 12. Composition according to claim 7, characterized in that the aforementioned silicone benzotriazole is the < RTI ID=14.13> 2 (2H-benzotriazole-2-yl) 4-methyl-6 [2-methyl-3 [1, < /RTI> 3,3,3< RTI ID=14.14> tétraméthyl-1-< /RTI> [(triméthylsilyl) oxy] < RTI ID=14.15> disiloxanyl] < /RTI> propynyl] phenol.
  - 13. Composition according to < RTI ID=14.16> one < /RTI> unspecified of the preceding claims, characterized in what it includes/understands from 0,5% to 20% in weight of liposoluble filter UV, compared to total weight of the composition.
  - 14. Composition according to claim 19, characterized in that it includes/understands of 0,5% to 10. % in weight of liposoluble filter UV, compared to the total weight of composition.
  - 15. Composition according to any of claims 1 to 14, characterized in it that it contains moreover at least a water-soluble filter UV.
  - 16. Composition according to claim 15, characterized in that the aforementioned filter UV water-soluble is selected among:
  - (1) filters derived from benzylidene < RTI ID=14.17>; < /RTI> (2) filters of the benzimidazole type or benzoxazole; (3) water-soluble benzophenone derivatives; and (4) their mixtures.
  - 17. Composition according to claim 16, characterized in that the aforementioned filter derived from benzylidene camphor is I' acid benzene 1,4- [di (3-méthylidènecampho 10< RTI ID=15.1> sulphonic)]. < /RTI>

- 18. Composition according to claim 16, characterized in that the aforementioned filter of the < type; RTI ID=15.2> benzimidazole< /RTI> or < RTI ID=15.3> benzoxazole< /RTI> < is acid I'; RTI ID=15.4> 2-phényl< /RTI> 5-sulphonic benzimidazole.
- 19. Composition according to claim 16, characterized in that the aforementioned water-soluble derivative of < RTI ID=15.5> benzophénone< /RTI> 2-hydroxy-4-méthoxy-benzophenone-5sulfonique is acid I'.
- 20. Cosmetic use of the composition according to < RTI ID=15.6> one < /RTI> unspecified of the claims the preceding ones to prevent or treat the signs of chronological cutaneous ageing or actinic.
- < RTI ID=15.7> 21.</ri>
  /RTI> Cosmetic use of the composition according to any of the claims 1 to 19 to prevent or treat the wrinkles and ridules and/or the cutaneous relaxation.
- 22. Use of the composition according to any of claims 1 to 19 for to manufacture a preparation intended to prevent or treat the signs of ageing cutaneous chronological or actinic.
- 23. Process of solubilization of at least a steroid chosen among: the DHEA and/or one biological precursor and/or a metabolic derivative of this one, including/understanding the stage consisting in mixing the aforementioned steroid with at least a liposoluble filter UV.

#### (12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

### (19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle

Bureau international



# 

(43) Date de la publication internationale 19 avril 2001 (19.04.2001)

PCT

## (10) Numéro de publication internationale WO 01/26618 A2

- (51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup>: A61K 7/42, 7/48
- (21) Numéro de la demande internationale:

PCT/FR00/02879

(22) Date de dépôt international:

13 octobre 2000 (13.10.2000)

(25) Langue de dépôt:

français

(26) Langue de publication:

français

(30) Données relatives à la priorité: 99/12773

- 13 octobre 1999 (13.10.1999) FR
- (71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US): L'OREAL [FR/FR]; 14, rue Royale, F-75008 Paris (FR).
- (72) Inventeur; et
- (75) Inventeur/Déposant (pour US seulement): BALDO, Francine [FR/FR]; 10, rue Paul Couderc, F-92330 Sceaux (FR).
- (74) Mandataire: RENARD, Emmanuelle; L'Oréal DPI, 6, rue Bertrand Sincholle, F-92585 Clichy Cedex (FR).

- (81) États désignés (national): AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (84) États désignés (régional): brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### Publiée:

Sans rapport de recherche internationale, sera republiée dès réception de ce rapport.

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) Title: COMPOSITION, ESPECIALLY A COSMETIC COMPOSITION, CONTAINING A STEROID AND A LIPOSOLU-**BLE UV FILTER** 

(54) Titre: COMPOSITION, NOTAMMENT COSMETIQUE, RENFERMANT UN STEROIDE ET UN FILTRE UV LIPOSO-LUBLE

- (57) Abstract: The invention relates to composition containing at least one steroid selected from: dihydroepiandrosterone and/or a biological precursor and/or a metabolic derivative thereof, in a physiologically suitable medium and characterised in that it also contains at least one liposoluble UV filter. Said liposoluble UV filter provides a means of preventing or delaying the crystallisation of the steroid. The invention also relates to the cosmetic and dermatological uses of the inventive composition, especially for preventing or treating chronological or actinic ageing of the skin.
- (57) Abrégé: La présente invention concerne une composition renfermant, dans un milieu physiologiquement acceptable, au moins un stéroïde choisi parmi: la DHEA et/ou un précurseur biologique et/ou un dérivé métabolique de celle-ci, caractérisée en ce qu'elle comprend en outre au moins un filtre UV liposoluble. Le filtre UV liposoluble permet d'éviter ou de retarder la cristallisation du stéroïde. L'invention concerne également les utilisations cosmétiques et dermatologiques de cette composition, notamment pour prévenir ou traiter le vieillissement cutané chronologique ou actinique.



30

## Composition, notamment cosmétique, renfermant un stéroïde et un filtre UV liposoluble

La présente invention se rapporte à une composition renfermant, dans un milieu physiologiquement acceptable, au moins un stéroïde choisi parmi : la DHEA et/ou un précurseur biologique et/ou un dérivé métabolique de celle-ci, caractérisée en ce qu'elle comprend en outre au moins un filtre UV liposoluble. Elle se rapporte également à ses utilisations, et à un procédé de solubilisation du stéroïde précité au moyen d'au moins un filtre UV liposoluble.

La DHEA, ou déhydroépiandrostérone, est un stéroïde naturel produit essentiellement par les glandes corticosurrénales. Elle est connue pour sa capacité à promouvoir la kératinisation de l'épiderme (JP-07 196 467), ou encore dans le traitement des peaux sèches, en raison de son aptitude à augmenter la production endogène et la sécrétion de sébum et à renforcer l'effet barrière de la peau (US-4,496,556). Il a également été décrit dans le brevet US-5,843,932 l'utilisation de la DHEA pour remédier à l'atrophie du derme par inhibition de la perte de collagène et de tissu conjonctif. Il a enfin été proposé d'utiliser le sulfate de DHEA pour traiter différents signes du vieillissement tels que les rides, la perte d'éclat de la peau et le relâchement cutané (EP-0 723 775).

20 On comprend donc l'intérêt qu'il peut y avoir à utiliser la DHEA dans des compositions cosmétiques ou dermatologiques.

Or, la DHEA ne se solubilise que difficilement dans les milieux aqueux et hydroalcooliques, ce qui limite sa formulation dans des compositions cosmétiques ou dermatologiques appliquées par voie topique ou orale. Elle a ainsi tendance à recristalliser ou à se dégrader. Il s'ensuit une perte d'efficacité plus ou moins importante de ces compositions, selon le degré de recristallisation et/ou de dégradation, ce qui va à l'encontre de l'objectif recherché. En outre, cette recristallisation ou dégradation peut modifier la stabilité globale de ces compositions ainsi que leur aspect, ce qui peut détourner l'utilisateur de celles-ci.

Il subsiste donc le besoin de solubiliser la DHEA, ainsi que ses précurseurs et/ou dérivés posant les mêmes problèmes de recristallisation, dans un solubilisant physiologiquement acceptable.

La Demanderesse a maintenant constaté, de façon étonnante, que ces composés pouvaient être facilement solubilisés dans les filtres UV liposolubles.

La présente invention a donc pour objet une composition renfermant, dans un milieu physiologiquement acceptable, au moins un stéroïde choisi parmi : la DHEA et/ou un précurseur biologique et/ou un dérivé métabolique de celle-ci, caractérisée en ce qu'elle comprend en outre au moins un filtre UV liposoluble.

Elle a également pour objet un procédé de solubilisation d'au moins un stéroïde choisi parmi : la DHEA et/ou un précurseur biologique et/ou un dérivé métabolique de celleci, comprenant l'étape consistant à mélanger ledit stéroïde à au moins un filtre UV liposoluble.

Le mélange peut être effectué à froid, à température ambiante ou à chaud, par exemple à 75°C, généralement sous agitation.

La DHEA a la formule (I) suivante :

20

30

La DHEA utilisable selon l'invention est par exemple disponible auprès de la société AKZO NOBEL.

Par "précurseurs biologiques" de la DHEA, on entend notamment la  $\Delta 5$ -prégnénolone et la  $17\alpha$ -hydroxy prégnénolone, sans que cette liste soit limitative.

Par dérivés métaboliques de la DHEA, on entend notamment le  $\Delta 5$ -androstène-3,17-diol et la  $\Delta 4$ -androstène-3,17-dione, ainsi que la  $7\alpha OH$ -DHEA, la  $7\beta OH$ -DHEA et la 7-céto-DHEA, sans que cette liste soit limitative. La  $7\alpha OH$ -DHEA est préférée pour une utilisation dans la présente invention.

- 5 Comme exemples de filtres UV liposolubles, on peut citer :
  - (1) les dérivés de l'acide salicylique tels que le salicylate d'homomenthyle, le salicylate de 2-éthylhexyle, le salicylate de triéthanolamine, le salicylate de 4-isopropylbenzyle;
- (2) les dérivés de l'acide cinnamique tels que le 4-méthoxy cinnamate d'isopentyle, le 4-méthoxy cinnamate de 2-éthylhexyle, le diisopropyl cinnamate de méthyle, le 4méthoxy cinnamate d'isoamyle, le 4-méthoxy cinnamate de diéthanolamine;
  - (3) les dérivés de β,β'-diphénylacrylate liquides ;

15

- (4) les dérivés de l'acide para-aminobenzoïque tels que le p-diméthylaminobenzoate de 2-éthylhexyle et le p-aminobenzoate de glycérol ;
- (5) les dérivés de dibenzoylméthane ;

20

- (6) les dérivés liposolubles de benzophénone ;
- (7) les silicones benzotriazoles décrites notamment dans la demande de brevet EP-A-0 392 883 ;

25

- (8) les dérivés siliciés de Benzimidazolyl-Benzazoles N-substitués ou de Benzofuranyl-Benzazoles décrits notamment dans la demande de brevet EP-1 028 120 ; et
- (9) leurs mélanges.

30

Parmi les dérivés de l'acide salicylique utilisables selon l'invention, on choisira plus particulièrement :

- le salicylate d'homomenthyle (connu aussi sous le nom d'homosalate), vendu notamment sous la dénomination de "KEMESTER HMS" par la Société Witco. Il répond à la formule suivante :

5

- le salicylate d'octyle vendu notamment sous la dénomination commerciale de "UVINUL O-18" par la Société BASF, et il répond à la formule suivante :

10

Les dérivés  $\beta$ ,  $\beta$ '-diphénylacrylates liquides utilisables selon la présente invention sont choisis de préférence parmi ceux répondant à la formule suivante :

15

dans laquelle:

- R<sub>7</sub> et R'<sub>7</sub>, identiques ou différents, sont en position méta ou para et sont choisis parmi
   : l'hydrogène; un radical alcoxy en C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> à chaîne droite ou ramifiée; un radical alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> à chaîne droite ou ramifiée;
  - R<sub>8</sub> représente un radical alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> à chaîne droite ou ramifiée;

- R<sub>9</sub> représente un atome d'hydrogène ou un radical -CN.

Parmi les dérivés β,β'-diphénylacrylates liquides de formule (V) utilisables selon la présente invention, on préfère plus particulièrement l'α-cyano-β,β' diphénylacrylate de 2-éthylhexyle, encore appelé octocrylène, et connu pour être un filtre lipophile absorbant dans les UVB. Il est disponible commercialement et vendu notamment sous la dénomination de "UVINUL N 539" par la Société BASF. Il répond à la formule suivante :

10

dans laquelle \( \phi \) désigne un radical phényle.

15

Parmi les dérivés de l'acide cinnamique mentionnés ci-dessus, on préfère tout particulièrement, selon la présente invention, mettre en oeuvre le p-méthoxycinnamate de 2-éthylhexyle, vendu notamment sous le nom commercial « PARSOL MCX » par la Société GIVAUDAN ; ce filtre répond à la formule développée suivante :

20

Parmi les dérivés de l'acide p-aminobenzoïque, on choisira plus particulièrement le para-diméthylaminobenzoate de 2-éthylhexyle vendu notamment sous la dénomination de "ESCALOL 507" par la Société ISP.

5

Comme dérivés de dibenzoylméthane, on préfère en particulier utiliser le 4-(tert-butyl) 4'-méthoxy dibenzoylméthane, notamment celui proposé à la vente sous la dénomination commerciale de "PARSOL 1789" par la Société GIVAUDAN.

10 Parmi les dérivés liposolubles de benzophénone, on peut citer la 2-hydroxy-4-méthoxy-benzophénone, encore appelé oxybenzone (benzophénone-3) comme le produit vendu sous le nom UVINUL M40 par la société BASF.

Comme silicones benzotriazoles, on préfère utiliser le composé de formule suivante, ou 2-(2H-benzotriazole-2-yl)-4-méthyl-6-[2-méthyl-3-[1,3,3,3-tétraméthyl-1-[(triméthylsilyl)oxy] disiloxanyl]propynyl]phénol :

- Les dérivés siliciés de Benzimidazolyl-Benzazoles N-substitués ou de Benzofuranyl-Benzazoles convenant particulièrement bien à une utilisation dans la présente invention sont notamment :
  - le 2-[1-[3-[1,3,3,3-tétraméthyl-1-[(triméthylsilyl)oxy]disiloxanyl]propyl]-1H-benzimidazol-2-yl]-benzoxazole
- le 2-[1-[3-[1,3,3,3-tétraméthyl-1-[(triméthylsilyl)oxy]disiloxanyl]propyl]-1H-benzimidazol-2-yl]-benzothiazole
  - le 2-[1-(3-trimethylsilanyl-propyl)-1H-benzimidazol-2-yl]-benzoxazole

WO 01/26618 7 PCT/FR00/02879

- le 6-méthoxy-1,1'-bis-(3-triméthylsilanyl-propyl)-1H,1'H-[2,2']bibenzimidazolyl-benzoxazole

- le 2-[1-(3-trimethylsilanyl-propyl)-1H-benzimidazol-2-yl]-benzothiazole.

La concentration en stéroïde dans la composition selon l'invention est avantageusement comprise entre 0,001% et 20% en poids, de préférence entre 0,01 et 10% en poids, plus préférentiellement entre 0,1 et 3% en poids, par rapport au poids total de la composition. En outre, la quantité pondérale de filtre UV liposoluble représente avantageusement de 0,5% à 20%, mieux, de 0,1 à 10%, du poids total de la composition.

La composition selon l'invention peut se présenter sous toutes les formes galéniques normalement utilisées pour une application topique sur la peau, notamment sous forme d'une solution huileuse, d'une émulsion huile-dans-eau ou eau-dans-huile ou multiple, d'une émulsion siliconée, d'une microémulsion ou nanoémulsion, d'un gel huileux ou d'un produit anhydre liquide, pâteux ou solide.

Cette composition peut être plus ou moins fluide et avoir l'aspect d'une crème blanche ou colorée, d'une pommade, d'un lait, d'une lotion, d'un sérum, d'une pâte, d'une mousse ou d'un gel. Elle peut éventuellement être appliquée sur la peau sous forme d'aérosol. Elle peut également se présenter sous forme solide, et par exemple sous forme de stick. Elle peut être utilisée comme produit de soin et/ou comme produit de maquillage de la peau, ou comme produit capillaire, par exemple comme shampooing ou après-shampooing.

25

30

20

De façon connue, la composition de l'invention peut contenir également les adjuvants habituels dans les domaines cosmétique et dermatologique, tels que les gélifiants hydrophiles ou lipophiles, les actifs hydrophiles ou lipophiles, les conservateurs, les antioxydants, les solvants, les parfums, les charges, les pigments, les absorbeurs d'odeur et les matières colorantes. Les quantités de ces différents adjuvants sont celles classiquement utilisées dans les domaines considérés, et par exemple de 0,01 à 20 % du poids total de la composition. Ces adjuvants, selon leur nature, peuvent être introduits dans la phase grasse, dans la phase aqueuse, dans les vésicules lipidiques et/ou dans les nanoparticules. Ces adjuvants, ainsi que leurs concentrations, doivent

être tels qu'ils ne nuisent pas aux propriétés avantageuses des stéroïdes selon l'invention.

Ainsi, en fonction du Facteur de Protection Solaire que l'on souhaite conférer à la composition selon l'invention, celle-ci pourra avantageusement renfermer un ou plusieurs filtres UV hydrosolubles.

Comme exemples de filtres UV hydrosolubles, on peut citer notamment :

- 10 (1) les filtres dérivés du benzylidène camphre, dont un exemple particulièrement préféré est l'acide benzène 1,4-[di(3-méthylidènecampho 10-sulfonique)] décrit notamment dans les demandes de brevets FR-A- 2 528 420 et FR-A- 2 639 347 :
- (2) les filtres du type benzimidazole ou benzoxazole, tels que l'acide 2-phényl
   15 benzimidazole 5-sulfonique, disponible auprès de la société MERCK sous la dénomination commerciale EUSOLEX 232;
- (3) les dérivés hydrosolubles de benzophénone, tels que l'acide 2-hydroxy-4-méthoxy-benzophénone-5-sulfonique, ainsi que sa forme sulfonate de sodium (benzophénone 5) vendue sous le nom UVINUL MS 40 par la société BASF; et
  - (4) leurs mélanges.

Lorsque la composition selon l'invention est une émulsion, la proportion de la phase grasse peut aller de 5 à 80 % en poids, et de préférence de 5 à 50 % en poids par rapport au poids total de la composition. Les matières grasses, les émulsionnants et les coémulsionnants utilisés dans la composition sous forme d'émulsion sont choisis parmi ceux classiquement utilisés dans le domaine considéré. L'émulsionnant et le coémulsionnant sont de préférence présents, dans la composition, en une proportion allant de 0,3 à 30 % en poids, et de préférence de 0,5 à 20 % en poids par rapport au poids total de la composition.

Comme matières grasses utilisables dans l'invention, on peut utiliser les solubilisants à base de 2-alkyl alcanols et de leurs esters, les huiles et notamment les huiles

minérales (huile de vaseline), les huiles d'origine végétale (huile d'avocat, huile de soja), les huiles d'origine animale (lanoline), les huiles de synthèse (perhydrosqualène), les huiles siliconées (cyclométhicone) et les huiles fluorées (perfluoropolyéthers). On peut aussi utiliser comme matières grasses des alcools gras tels que l'alcool cétylique, des acides gras, des cires et des gommes et en particulier les gommes de silicone.

Comme émulsionnants et coémulsionnants utilisables dans l'invention, on peut citer par exemple les esters d'acide gras et de polyéthylène glycol tels que le stéarate de PEG-100, le stéarate de PEG-50 et le stéarate de PEG-40; les esters d'acide gras et de polyol tels que le stéarate de glycéryle, le tristéarate de sorbitane et les stéarates de sorbitane oxyéthylénés disponibles sous les dénominations commerciales Tween® 20 ou Tween® 60, par exemple ; et leurs mélanges.

15 Comme gélifiants hydrophiles, on peut citer en particulier les polymères carboxyvinyliques (carbomer), les copolymères acryliques tels que les copolymères d'acrylates/alkylacrylates, les polyacrylamides, les polysaccharides, les gommes naturelles et les argiles, et, comme gélifiants lipophiles, on peut citer les argiles modifiées comme les bentones, les sels métalliques d'acides gras et la silice 20 hydrophobe.

La composition selon l'invention trouve en particulier une application dans la prévention et le traitement des signes du vieillissement chronologique ou actinique, ainsi que dans le traitement de certaines pathologies.

25

10

La présente invention concerne donc également l'utilisation cosmétique de la composition mentionnée ci-dessus pour prévenir ou traiter les signes du vieillissement cutané chronologique ou actinique, en particulier les rides et ridules et/ou le relâchement cutané.

30

Plus particulièrement, la composition selon l'invention est destinée à la prévention ou au traitement du vieillissement actinique.

La présente invention concerne également l'utilisation de la composition mentionnée ci-dessus pour fabriquer une préparation destinée à prévenir ou traiter les signes du vieillissement cutané chronologique ou actinique.

Dans tous les cas, la composition selon l'invention et/ou la préparation obtenue à partir de celle-ci comprend une quantité efficace de stéroïde, suffisante pour obtenir l'effet recherché, et un milieu physiologiquement acceptable

L'invention sera maintenant illustrée par les exemples non limitatifs suivants. Dans ces exemples, les quantités sont indiquées en pourcentage pondéral, sauf indication contraire.

#### **EXEMPLES**

## 15 Exemple 1 : mise en évidence de l'effet solubilisant des filtres UV liposolubles

On prépare trois compositions C1 à C3 telles que définies dans le Tableau 1.

TABLEAU 1

	C1		C2		СЗ	
Distéarate polyglycérolé (2 mol)	2	%	2	%	2	%
Mono-stéarate de PEG (8 OE)	1,35	%	1,35	%	1,35	%
Acide stéarique	1	%	1	%	1	%
Conservateurs	1,35	%	1,35	%	1,35	%
DHEA	1	%	1	%	1	%
Octyl méthoxycinnamate	5	%	0	%	0	%
Octocrylène	0	%	5	%	0	%
Benzoate d'alcools en C <sub>12-15</sub>	15	%	20	%	25	%
Neutralisants	0,45	%	0,45	%	0,45	%
Propylène glycol	10	%	10	%	10	%
Gélifiant	0,5	%	0,5	%	0,5	%
Eau	qsp 1	00 %	qsp 1	00 %	qsp 16	00 %

Après quinze jours à 4°C ou à température ambiante, les compositions C1 et C2 ne présentent pas de cristaux de DHEA, tandis que la composition C3 présente déjà des cristaux de DHEA, visibles au microscope sous lumière polarisée, au bout de 24 heures de stockage à 4°C ou à température ambiante.

5

Il ressort donc clairement du Tableau 1 que les filtres UV liposolubles permettent de solubiliser la DHEA, ou un autre stéroïde.

## Exemple 2 : composition cosmétique

10

	Butyl méthoxy dibenzoylméthane		5	%
	7αOH-DHEA		1	%
	Distéarate polyglycérolé (2 mol)		2	%
	Mono-stéarate de PEG (8 OE)		1,3	5%
15	Acide stéarique		1	%
	Propylène glycol		10	%
	Conservateur		1,3	5%
	Gélifiant		0,5	%
	Neutralisants		0,45%	
20	Eau	qsp	100	%

La composition ci-dessus peut être utilisée comme crème de soin destinée à lutter contre les rides et à prévenir la perte de fermeté et d'élasticité de la peau.

## Exemple 3 : composition cosmétique

25

Octyl salicylate	5	%
7-céto-DHEA	1	%
Distéarate polyglycérolé (2 mol)	2	%
Mono-stéarate de PEG (8 OE)	1,3	
Acide stéarique	1	%
Propylène glycol	10	%
Conservateur	1,3	
Gélifiant	0,5	%
	7-céto-DHEA Distéarate polyglycérolé (2 mol) Mono-stéarate de PEG (8 OE) Acide stéarique Propylène glycol Conservateur	7-céto-DHEA  Distéarate polyglycérolé (2 mol)  Mono-stéarate de PEG (8 OE)  Acide stéarique  Propylène glycol  Conservateur  1,3

Neutralisants		0,45%		
Eau ·	asp	100	%	

La composition ci-dessus peut être utilisée comme crème de jour anti-âge.

5

## Exemple 4 : composition cosmétique

	Silicone benzotriazole*		5	%
	DHEA		1	%
10	Distéarate polyglycérolé (2 mol)		2	%
	Mono-stéarate de PEG (8 OE)	1,35%		
	Acide stéarique		1	%
	Propylène glycol		10	%
15	Conservateur		1,35	5%
	Gélifiant		0,5	%
	Neutralisants		0,45	5%
	Eau	qsp	100	%

<sup>\* 2-(2</sup>H-benzotriazole-2-yl)-4-méthyl-6-[2-méthyl-3-[1,3,3,3-tétraméthyl-1-[(triméthylsilyl)oxy] disiloxanyl]propynyl]phénol, décrit dans la demande de brevet EP-A-0 392 883.

Cette composition peut être utilisée pour prévenir ou traiter les signes du vieillissement tels que les rides et ridules et le relâchement cutané.

#### REVENDICATIONS

- Composition renfermant, dans un milieu physiologiquement acceptable, au moins un stéroïde choisi parmi : la DHEA et/ou un précurseur biologique et/ou un dérivé
   chimique ou métabolique de celle-ci, caractérisée en ce qu'elle comprend en outre au moins un filtre UV liposoluble.
  - 2. Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce que ledit précurseur biologique est choisi parmi : la Δ5-prégnénolone et la 17α-hydroxy prégnénolone.
  - 3. Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée en ce que ledit dérivé métabolique est choisi parmi : le  $\Delta 5$ -androstène-3,17-diol et la  $\Delta 4$ -androstène-3,17-dione, la  $7\alpha OH$ -DHEA, la  $7\beta OH$ -DHEA et la 7-céto-DHEA.
- 4. Composition selon la revendication 3, caractérisée en ce que ledit dérivé métabolique est la 7αOH-DHEA.
- 5. Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée en ce qu'elle renferme de 0,01 à 10% en poids de stéroïde, par rapport au poids total
  20 de la composition.
  - 6. Composition selon la revendication 5, caractérisée en ce qu'elle renferme de 0,1 à 3% en poids de stéroïde, par rapport au poids total de la composition.
- 7. Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée en ce que ledit filtre UV liposoluble est choisi parmi :
  - (1) les dérivés de l'acide salicylique ;
  - (2) les dérivés de l'acide cinnamique ;
- 30 (3) les dérivés de β,β'-diphénylacrylate liquides ;
  - (4) les dérivés de l'acide para-aminobenzoïque ;
  - (5) les dérivés de dibenzoylméthane ;
  - (6) les dérivés liposolubles de benzophénone :
  - (7) les silicones benzotriazoles ;

- (8) les dérivés siliciés de Benzimidazolyl-Benzazoles N-substitués ou de Benzofuranyl-Benzazoles:; et
- (9) leurs mélanges.

20

- 5 8. Composition selon la revendication 7, caractérisée en ce que ledit dérivé d'acide salicylique est choisi parmi le salicylate d'octyle et le salicylate d'homomenthyle.
  - 9. Composition selon la revendication 7, caractérisée en ce que ledit dérivé d'acide cinnamique est le 4-méthoxycinnamate de 2-éthylhexyle.
  - 10. Composition selon la revendication 7, caractérisée en ce que ledit dérivé de  $\beta$ , $\beta$ '-diphénylacrylate est l' $\alpha$ -cyano- $\beta$ , $\beta$ ' diphénylacrylate de 2-éthylhexyle.
- 11. Composition selon la revendication 7, caractérisée en ce que Jedit dérivé de dibenzoylméthane est le 4-(tert-butyl) 4'-méthoxy dibenzoylméthane.
  - 12. Composition selon la revendication 7, caractérisée en ce que ladite silicone benzotriazole est le 2-(2H-benzotriazole-2-yl)-4-méthyl-6-[2-méthyl-3-[1,3,3,3-tétraméthyl-1-[(triméthylsilyl)oxy] disiloxanyl]propynyl]phénol.
  - 13. Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée en ce qu'elle comprend de 0,5% à 20% en poids de filtre UV liposoluble, par rapport au poids total de la composition.
- 25 14. Composition selon la revendication 19, caractérisée en ce qu'elle comprend de 0,5% à 10.% en poids de filtre UV liposoluble, par rapport au poids total de la composition.
- 15. Composition selon l'une quelconque des revendications 1 à 14, caractérisée en ce qu'elle renferme en outre au moins un filtre UV hydrosoluble.
  - 16. Composition selon la revendication 15, caractérisée en ce que ledit filtre UV hydrosoluble est choisi parmi :
  - les filtres dérivés du benzylidène camphre ;

- (2) les filtres du type benzimidazole ou benzoxazole;
- (3) les dérivés hydrosolubles de benzophénone ; et
- (4) leurs mélanges.

- 5 17. Composition selon la revendication 16, caractérisée en ce que ledit filtre dérivé de benzylidène camphre est l'acide benzène 1,4-[di(3-méthylidènecampho 10sulfonique)].
- 18. Composition selon la revendication 16, caractérisée en ce que ledit filtre de type 10 benzimidazole ou benzoxazole est l'acide 2-phényl benzimidazole 5-sulfonique.
  - 19. Composition selon la revendication 16, caractérisée en ce que ledit dérivé hydrosoluble de benzophénone est l'acide 2-hydroxy-4-méthoxy-benzophénone-5-sulfonique.
  - 20. Utilisation cosmétique de la composition selon l'une quelconque des revendications précédentes pour prévenir ou traiter les signes du vieillissement cutané chronologique ou actinique.
- 21. Utilisation cosmétique de la composition selon l'une quelconque des revendications
   1 à 19 pour prévenir ou traiter les rides et ridules et/ou le relâchement cutané.
- 22. Utilisation de la composition selon l'une quelconque des revendications 1 à 19 pour fabriquer une préparation destinée à prévenir ou traiter les signes du vieillissement
   25 cutané chronologique ou actinique.
  - 23. Procédé de solubilisation d'au moins un stéroïde choisi parmi : la DHEA et/ou un précurseur biologique et/ou un dérivé métabolique de celle-ci, comprenant l'étape consistant à mélanger ledit stéroïde à au moins un filtre UV liposoluble.